

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. August 2005 (11.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/073215 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 333/14,
333/20

AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000420

(22) Internationales Anmeldedatum:
18. Januar 2005 (18.01.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 004 719.7 29. Januar 2004 (29.01.2004) DE

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF Aktiengesellschaft [DE/DE]; 67056
Ludwigshafen (DE).

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): STÜRMER, Rainer
[DE/DE]; Hauptstr. 153, 67127 Rödersheim-Gronau (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF Aktiengesellschaft;
67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING ENANTIOMER-PURE AMINOALCOHOLS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON ENANTIOMERENREINEN AMINOALKOHOLEN

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing the enantiomer-pure aminoalcohol of formula (1), by (i) reducing the ketone of formula (3) to the racemic alcohol of formula (4), (ii) enantioselectively acylating the racemic alcohol of formula (4) with succinic anhydride in the presence of a lipase to the succinic acid semi-ester of formula (7), (iii) removing the succinic acid semi-ester of formula (7) from the unreacted enantiomer of formula (4), and (iv) reacting the enantiomer-pure alcohol of formula (4) with methylamine to give the enantiomer-pure alcohol of formula (1).

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von enantiomerenreinem Alkohol der Formel 1, wo-
bei man (i) das Keton der Formel 3 zum racemischen Alkohol der Formel 4 reduziert, (ii) den racemischen Alkohol der Formel 4
mit Bernsteinsäureanhydrid in Gegenwart einer Lipase enantioselektiv zum Bernsteinsäurehalbester der Formel 7 acyliert, (iii) den
Bernsteinsäurehalbester der Formel 7 vom nicht-umgesetzten Enantiomer der Formel 4 trennt, (iv) den enantiomerenreinen Alko-
hol der Formel 4 mit Methylamin zum enantiomerenreinen Alkohol der Formel 1 umsetzt.

WO 2005/073215 A1